

Les antihistaminiques

Module de : Pharmacologie

D'après les cours de Mme.Bensegueni

2010-2011©B_Integra

[HTTP://VETO-CONSTANTINE.COM](http://veto-constantine.com)

L'HISTAMINE :

- L'histamine est le produit de décarboxylation de l'histidine, elle est retrouvée partout où la protéolyse se fait, en présence des micro-organismes de putréfaction.
- L'histamine est une substance régulière de l'organisme on l'a retrouve dans le sang, dans le foie et même un peu dans le poumon et la peau.
- Dans l'intestin, on la retrouve mêlée à la putrescine et à la cadavérine.
- L'histamine est largement distribuée dans les cellules des organes, liée au protoplasme, surtout les mastocytes, un peu moins les basophiles, les cellules endothéliales, les cellules de la muqueuse digestive.
- L'histamine se trouve cependant libérée sous forme active lorsque les cellules sont exposées à une agression.
- D'autres médiateurs chimiques : **Sérotonine, Angiotensine, Prostaglandines...** interviennent en même temps que l'histamine, mais à des taux plus faibles, ils participent ainsi à l'entretien de la deuxième douleur de l'inflammation.
- La libération pathologique de l'histamine et des autres médiateurs au-delà des taux physiologiques est induite dans l'organisme par des molécules dites « Allergènes », cette libération détermine alors la : **Réaction allergique.**
- La forme active de l'histamine possède plusieurs sites :
 - Sites H1.
 - Sites H2.
 - Sites H 3.
- Chez tous les mammifères, excepté le rat :
 - l'histamine stimule la musculature utérine et intestinale.
 - L'histamine relâche le tonus des capillaires, ce qui conduit à la : **Vasodilatation.**
 - L'histamine provoque au niveau des bronches de la : **Bronchostriction.**
 - L'histamine, production physiologique de l'organisme, joue un rôle de neurotransmetteur au niveau du SNC.
- À doses élevées, l'histamine provoque une fuite généralisée des liquides et des protéines plasmatiques, il s'en suit de l'hémoconcentration et une résorption insuffisante, ce qui conduit à : **l'Œdème.**
- Toujours à dose élevée, elle provoque de l'hypersécrétion gastrique par stimulation des glandes salivaires et surtout des glandes gastriques ce qui conduit à : l'irritation de la muqueuse, donc : **la Rougeur.**
- À dose encore plus forte, elle altère le myocarde, entraîne des troubles de la conductibilité de l'irrigation du cœur.
- Injectée en intradermique même à très faible concentration, elle produit des réactions circulatoires locales, de type inflammatoires.
- Selon la quantité d'histamine libérée dans l'organisme, la réaction allergique peut être légère et localisée, on observe :
 - ❖ Des allergies respiratoires, digestives, ophtalmiques, cardiaques et nerveuses ; la plus banale reste : « **l'allergie cutanée** ».
 - ❖ Comme, elle peut être violente, aiguë ou suraiguë et provoquer ce qu'on appelle : « **le Choc anaphylactique** ».

L'évolution du choc anaphylactique est souvent fatale et peut se présenter chez l'animal suivant 2 types de tableaux cliniques :

- ✓ Tableau clinique respiratoire et cardiaque où la mort peut survenir en 30 min, suite à une augmentation rapide et très irrégulière de la respiration et de la pulsation cardiaque.
- ✓ Tableau clinique cutané et de la face : c'est l'**œdème de Quincke**, l'animal meurt par étouffement suite à l'inflammation généralisée des tissus muqueux des voies respiratoires supérieures du larynx et de la glotte.

Les Antihistaminiques de synthèse :

Ce sont des produits organiques de synthèse qui présentent une analogie de structure avec l'histamine, ce sont : **des antagonistes des récepteurs H.**

Ils présentent tous une activité antihistaminique remarquable, selon le type de récepteur, on distingue parmi les molécules de médicaments : les **anti H1** et les **anti H2**.

Propriétés pharmacologiques essentielles :

- Ce sont des molécules capables de protéger la plupart des espèces animales, contre plusieurs allergènes.
- Les antihistaminiques annulent l'effet de l'histamine sur la musculature lisse, bronchique et intestinale.
- Les antihistaminiques rééquilibrent la perméabilité des capillaires.
- Ils possèdent une action temporairement dépressive sur le système nerveux végétatif (cette propriété est exploitée lors du mal de transport).
- Ils dépriment aussi de façon temporaire, le centre du vomissement et de la toux (antitussifs et antivomitifs).
- Les antihistaminiques exercent parfois une action anti-inflammatoire générale.

Les effets secondaires des antihistaminiques :

- Des manifestations d'intolérance digestive, nausées et vomissements.
- Étourdissements, vertiges, tendance à la somnolence, faiblesse et fatigue extrême.
- Accidents de types allergiques.

Principaux antihistaminiques de synthèse :

❖ Les anti H1 :

Ils n'ont pas d'action au niveau des récepteurs gastriques, ils sont actifs au niveau des bronches, de l'intestin et du système vasculaire, en plus d'une action légèrement sédatrice et anesthésique.

- Leurs propriétés antihistaminiques sur les sites H1 sont élevées, possèdent des propriétés hypnotiques et antalgiques indiquées dans les états allergiques, états congestifs, œdème pulmonaire, fourbure, diarrhée.
- Principales molécules utilisées aussi bien chez l'homme que chez l'animal :
 - ✓ **Ethanolomine.**
 - ✓ **Benzytaniline.**
 - ✓ **Pipérazine.**
 - ✓ **Phénothiazine** : 2 molécules essentielles utilisées en thérapeutique:
 - Prométhazine (PHENERGAN ND).
 - Oxoméazine (DOXERGAN ND).

❖ Les Anti H2 :

Ce sont tous les médicaments utilisés pour limiter les sécrétions digestives, très exploités dans le traitement de l'ulcère gastrique chez l'homme.

La principale molécule : **La Ranitidine et ses dérivés.**